

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005年4月21日 (21.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/035506 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 231/56, 401/04, A61K
31/416, 31/4439, A61P 27/06, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/015663

(22) 国際出願日: 2004年10月15日 (15.10.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2003-3549172003年10月15日 (15.10.2003) JP
特願 2004-270561 2004年8月20日 (20.08.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 宇部
興産株式会社 (UBE INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒
7808633 山口県宇部市大字小串 1 9 7 8 の 9 6 Yam-
aguchi (JP). 参天製薬株式会社 (SANTEN PHARMA-
CEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5338651 大阪府大阪
市東淀川区下新庄 3 丁目 9 番 19 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 萩原 昌彦 (HAG-
IHARA, Masahiko) [JP/JP]; 〒7808633 山口県宇部市
大字小串 1 9 7 8 の 5 宇部興産株式会社宇部研究
所内 Yamaguchi (JP). 小森 健一 (KOMORI, Ken-ichi)
[JP/JP]; 〒7808633 山口県宇部市大字小串 1 9 7 8 の
5 宇部興産株式会社宇部研究所内 Yamaguchi (JP). 砂
本 秀利 (SUNAMOTO, Hidetoshi) [JP/JP]; 〒7808633
山口県宇部市大字小串 1 9 7 8 の 5 宇部興産株式会
社宇部研究所内 Yamaguchi (JP). 西田 洋 (NISHIDA,
Hiroshi) [JP/JP]; 〒7808633 山口県宇部市大字小串
1 9 7 8 の 5 宇部興産株式会社宇部研究所内 Ya-
maguchi (JP). 松本 雄 (MATSUGI, Takeshi) [JP/JP]; 〒
6300101 奈良県生駒市高山町8916-16 参天製薬株式会
社 研究所内 Nara (JP). 中島 正 (NAKAJIMA, Tadashi)
[JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町8916-16 参天製薬株式会社 研究所内 Nara (JP). 桑野 正和 (HATANO,
Masakazu) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市高山町
8916-16 参天製薬株式会社 研究所内 Nara (JP). 木戸 一
貴 (KIDO, Kazutaka) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生駒市
高山町8916-16 参天製薬株式会社 研究所内 Nara (JP).
原 英彰 (HARA, Hideaki) [JP/JP]; 〒6300101 奈良県生
駒市高山町8916-16 参天製薬株式会社 研究所内 Nara
(JP).(74) 代理人: 日比 紀彦, 外 (HIBI, Norihiko et al.); 〒
5420086 大阪府大阪市中央区西心斎橋 1 丁目 1 3 番
1 8 号イナバビル 3 階 キシモト特許事務所内 Osaka
(JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

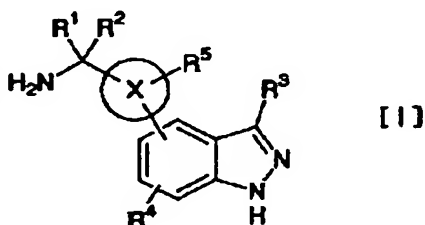
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL INDAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規インダゾール誘導体



[1]

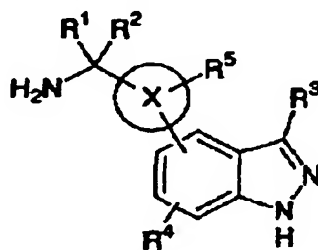
(57) Abstract: To prepare a novel indazole derivative useful as a medicine and to
find out a new pharmacological activity of the derivative. The compound is repre-
sented by the general formula [I] and has excellent Rho-kinase inhibitory activity.
In the formula, ring X is a benzene ring or pyridine ring; R¹ and R² each is hydrogen
or alkyl; R³ and R⁴ each is halogeno, hydrogen, OH, alkoxy, alkenyloxy, alkyn-
yloxy, cycloalkyloxy, cycloalkenyloxy, aryloxy, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl,
cycloalkenyl, aryl, carboxy, hydrocarbonyl, alkylcarbonyl, etc.; and R⁵ is halogeno,
hydrogen, OH, alkoxy, aryloxy, alkyl, or aryl. These groups may be substituted.

[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、医薬として有用な新規インダゾール誘導体を創製し、その誘導体の新たな薬理作用を見出すことを目的とする。本発明化合物は一般式〔I〕で示され、優れたRhoキナーゼ阻害作用を有する。式中、環Xはベンゼン環、又はピリジン環を；R¹とR²はH又はアルキルを；R³とR⁴は、ハロゲン、H、OH、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキルオキシ、シクロアルケニルオキシ、アリールオキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、カルボキシ、ヒドロカルボニル、アルキルカルボニル等を；R⁵はハロゲン原子、H、OH、アルコキシ、アリールオキシ、アルキル、又はアリールを示す。各基は置換基を有してもよい。



〔I〕